

[19] 中华人民共和国专利局

[11] 公开号 CN 1067054A



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 92103697.3

[51] Int.Cl⁵

C07D261/08

[43] 公开日 1992 年 12 月 16 日

[22] 申请日 92.5.18

[30] 优先权

[32] 91.5.20 [33] GB [31] 9110858.9

[71] 申请人 国际壳牌研究有限公司

地址 荷兰海牙

[72] 发明人 D·芒罗

B·帕特尔

[74] 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利

代理部

代理人 徐汝巽

A01N 43/80

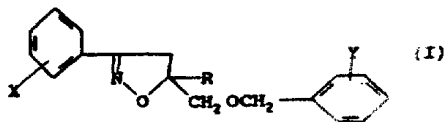
说明书页数: 24

附图页数:

[54] 发明名称 除草化合物

[57] 摘要

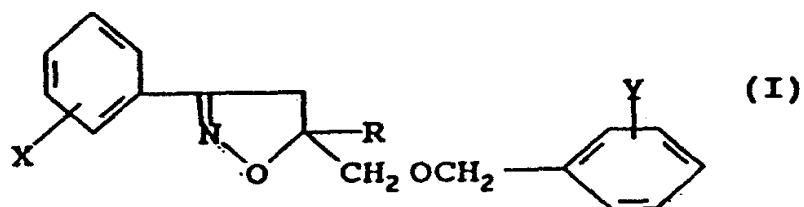
式 I 所示化合物, 式中 X 是硝基, Y 是氢或卤素, R 是 C₁₋₆ 烷基。它们用作除草剂, 特别是用作针对谷类作物中杂草的除草剂。



<20>

权 利 要 求 书

1. 通式(I)所示的化合物



式中

X 代表硝基;

Y 代表氢或卤素原子;

R 代表 C₁-6 烷基。

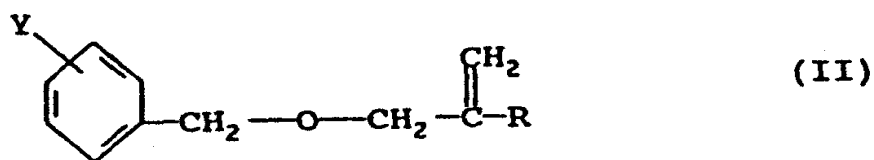
2. 权利要求 1 中的化合物,其中硝基 X 在与异恶唑环连接键的邻位。

3. 权利要求 1 或 2 中的化合物,其中 Y 代表氢或氟原子,

4. 权利要求 3 中的化合物,式中 Y 为 2 位氟原子。

5. 权利要求 1 到 4 任一项中的化合物,式中 R 代表甲基,

6. 权利要求 1 中化合物的制备方法,包括通式 II 所示的化合物与通式 III 所示的化合物在缚酸剂和有机溶剂的存在下的反应。



式中 Y 和 R 如权利要求 1 的定义



式中 X 如权利要求 1 的定义, Hal 代表卤素原子。

7. 除草组合物, 由权利要求 1 到 5 中任一项要求的化合物和载体组成。

8. 抑制不需要植物生长的方法, 包括用权利要求 1 到 5 的任何一项所要求的化合物或权利要求 7 所要求的组合物处理施药点。

9. 权利要求 8 中的方法, 其中施药点是谷类作物所在场所。

10. 权利要求 1 到 5 任一项要求的化合物作为除草剂的应用。

除草化合物

本发明涉及了某些异恶唑啉类化合物,以及它们的制备方法和作为除草剂的应用。

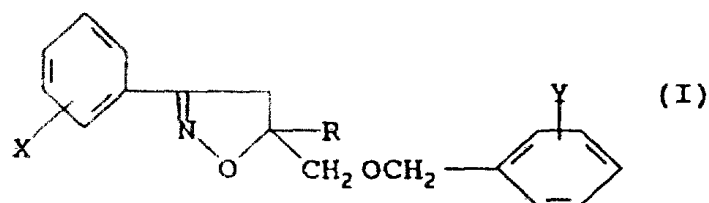
稗是一种重要的年生杂草,对于谷类作物尤为如此,因此需要开发选择性除草剂来防治稗而又不损害谷类植物。随着人们对化学 品进入环境的残留量的关心的不断加强,合于需要的是,这种选择性应该在低剂量下达到,谷类可以由移植或直接播种来栽培,稗(*Echinochloa*)是这两类作物的重要的杂草,稻田中特别重要的稗是 *Echinochloa oryzicola*。

欧洲专利说明书No.334120A1 公开了一大类异恶唑啉化合物,特别是其中的 128 个化合物被确定可以作为除草剂,这些化合物是在温室中试验的,施用比例为 0.5 和 1.0 千克/公顷活性组份,结果表明某些化合物在防治油菜和向日葵作物的杂草和藜时特别有用,后者通常侵袭北欧谷类作物,玉米、土豆、甜菜和向日葵。温室试验中采用的受试植物还包括稗(*Echinochloa crus-galli*),这是一种普通的稗,但是对于这种稗没有显著的除草活性。

现已发现在欧洲专利说明书所述的异恶唑啉范围之外有一小组

异恶唑啉具有特殊有用的除草性质,特别是这些新化合物在低剂量下对重要的稗类显示了相当高的除草活性,但是其剂量却高于欧洲专利说明书 EP-A 334120 公开的结构相似的化合物而需的剂量,然而对于谷类作物,无论是直播的或是移植的,都不显示有害的影响。

本发明提供了下述通式所示的化合物



式中

X 代表硝基;

Y 代表氢或卤素原子;而

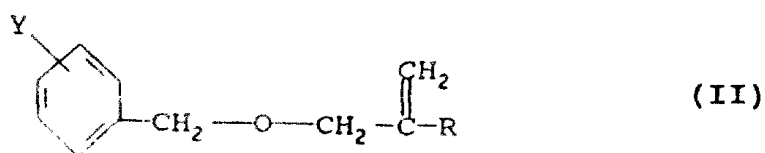
R 代表 C_1 —6 烷基。

硝基, X, 可以在 3-苯基的任何位置上,但优选的 X 在与异恶唑啉环相连的邻位上。

在本发明所述的化合物中的其它芳环可以是未取代的,这样 Y 就是氢,或者是被一个卤素原子取代的,适合的卤素是氟,氯,溴或碘,而优选氟为卤素取代基,取代可以发生在苯环的任何位置上,但最好在次甲基的邻位,也就是说最好是 Y 为 2-氟。

在异恶唑啉环 5-位上的基团 R 可以是直链的或者是支链的 C_1 —6 烷基,优选 C_1 —3 烷基,特别是甲基。

本发明也提供一制备通式 I 所示化合物的方法,其中包括在缚酸剂和有机溶剂的存在下通式 II 所示的苄基烯丙基醚与通式 III 所示的肟反应。



式中 Y 和 R 如前所述定义



式中 X 如前述所定义而 Hal 代表卤原子而优选氯或溴。

在反应中通式 III 所示的肟产生卤化氢,同时产生一个活泼的,并且不稳定的中间体氧化脒,它立刻就地与式 II 所示的苄基烯丙基醚反应而形成所需要的异恶唑啉,而缚酸剂消除了形成的卤化氢,可以方便地选择缚酸剂和溶剂使缚酸剂/卤化物副产物不溶于溶剂而易于分离。

适当的缚酸剂为一个三级胺,例如多至四个碳原子的三级烷基胺,适当的溶剂是多至四个碳原子的烷基醚,采用三乙胺为缚酸剂,二乙醚为溶剂是特别适宜的,优选过量的缚酸剂,例如多至过量 50%,通常过量 20%

这一加成反应的区域化学在本领域中是悉知,请见例如 1971

年 Springer Verlag 出版的，由 C. H. Grundmann 和 P. Grinager 著的“氧化脒”一书第 98 页。

本发明的制备方法一般是在低于室温温度下进行的，例如在 -20°C 到 20°C 的温度范围内进行，在 -10°C 到 10°C 范围内是适宜的，而在 0°C 是方便的。反应物采用 1:1 的摩尔比是适宜的。

采用干燥反应物并且在无水条件下进行反应是有利的。

在分离了缚酸剂/卤化氢副产物之后，本发明的异恶唑啉可以由常规技术分离、纯化。通常异恶唑啉是油状物，在蒸馏时，甚至在减压下蒸馏时都是不稳定的，因而不能用蒸馏来纯化。然而在放置后这种油可以固化，因而如果需要的话，可以由重结晶来进一步纯化。

在本发明的反应中应用的式 III 所示的脒应是新鲜制备的，引起卤化氢的消除和暂时的氧化脒中间体的形成需要脒的不稳定性，然而不幸的是，如果缺乏另一个反应物，则形成的氧化物将自相反应而产生不需要的呋噁烷。

通式 III 所示的化合物可用常规的卤化技术由相应的硝基苯甲醛脒制备。N-氯代丁二酰亚胺或 N-溴代丁二酰亚胺是适合的卤化剂，卤化通常在有机溶剂中进行，例如多至四个碳的二烷基甲酰胺，方便地是使用二甲基甲酰胺，并且在提高了的温度下进行，例如在 20°C 到 70°C 的温度范围内进行，适宜的是 50°C 。在向反应介质中加入卤化剂时要特别小心，在反应的早期阶段摇晃加入试剂是有益的。

用这样的方法制备的式Ⅲ所示的化合物可以方便地用溶剂提取的方法来纯化,例如用水和与本发明方法所要求的相同的有机溶剂,这样,可以直接使用反应剂以减小由于分解而形不需要的呋噻烷造成的损失。于是,采用水和二乙醚进行溶剂提取,接着干燥分离出的有机层,以保持制备异噻唑啉所需的干燥条件。

起始物硝基基本甲醛肟为已知化合物,或者可以用常规技术由相应的硝基苯甲醛来制备,后者都是商品化合物(例如,见 *Merck Index*, 11, 6508)。

式Ⅱ所示的苄基烯丙基醚可由2-(C₁-烷基)丙烯-1-醇或它们的盐与随意取代有卤原子的卤化苄的反应制备,在前者的分子中,其烷基相应于式Ⅰ的“R”,特别是甲基。在卤化苄的分子中卤原子氯或溴都是适宜的,而优选溴。反应在非质子溶剂中进行是适宜的。丙醇以盐的形式使用是适宜的,通常用碱金属盐,用钠盐是很方便的,这可用常规技术来制备,例如在有机溶剂中碱金属氢化物与丙醇反应。

起始物烷基丙烯-1-醇和需要的卤化苄是已知的或者容易由标准方法制备,例如溴化苄见 *Merck Index*, 11, 1142, 2-甲基丙烯-1-醇见 *Beilstein*, 1, 443。

本发明的化合物具有有趣的除草性质,而不管是芽前还是芽后,特别是对于重要杂草稗极其有效,即使在低剂量也保持其效果,此外,这些化合物有一个相关的谷物残留量,但对于直播的或是移

植的谷物品种，无论是在低剂量还是在高剂量下都无不利影响。

本发明的化合物在防治不需要的植物品种，例如谷类作物中的稗(*Echinochloa crus-galli*)，特别是稗(*Echinochloa oryzicola*)方面具有特别的应用。

相应地本发明还提供由前述定义的式 I 所示化合物和一种载体结合成的除草组合物，及其如何将式 I 所示化合物与载体相结合而制成这样的组合物的方法。

本发明也提供这些化合物或组合物作为除草剂的使用方法。此外，本发明还提供用本发明的化合物或组合物处理施药点而抑制施药点不需要植物的生长的方法，药物的施用可在芽前或芽后进行。使用的活性成分的剂量可以是在 0.01 到 10 千克/公顷的范围，而适宜的是 0.05 到 1 千克/公顷，而施药点可以是，例如是土地或植物，典型的作物是谷类，如稻类(*Oryza sativa*)，它们可以是直接播种的，也可以是移栽的。

本发明的组合物中的载体可以是任何物质，用它与活性成份一起加工以促进其施用于被处理的施药点，例如施用于植物，种子或土地，或者便于贮藏，运输或处理。载体可以是固体或液体，包括那些在通常情况下是气体，但可以压缩成液体的物质，以及在加工除草组合物时可以正常使用的任何载体，本发明的组合物优选含重量百分数为 0.5 至 95 的活性组份。

适宜的固体载体包括天然的和合成的粘土和硅酸盐，例如天然

硅石如硅藻土；硅酸镁，例如滑石；硅酸镁铝，例如绿坡缕石和蛭石；硅酸铝，例如，高岭土，蒙脱土和云母；碳酸钙；硫酸钙；硫酸铵；合成水合氧化硅以及合成的硅酸钙或硅酸铝；元素，例如碳和硫；天然和合成的树脂，例如香豆酮树脂，聚氯乙烯，和苯乙烯聚合物和共聚物；固体多氯酚；沥青；石蜡；以及固体肥料，例如过磷酸盐。

适宜的液体载体包括水；醇，例如异丙醇和乙二醇；酮，例如丙酮，甲乙酮，甲基异丁基酮和环乙酮；醚类；芳烃或芳烷烃，例如苯甲苯和二甲基；石油馏份，例如油和轻质矿物油；氯代烃，例如四氯化碳，过氯乙烯和三氯乙烯，各种液体的混合物常常也是适宜的。

常用组合物常常加工成浓缩的形式并以此用于运输，它们通常在施用前由使用者将其稀释，少量表面活性剂的存在可以促进这种稀释过程，这样，优选本发明的组合物中至少有一种载体是表面活性剂，例如，组合物可以至少含有两种载体，其中至少一种是表面活性剂。

表面活性剂可以是乳化剂，分散剂或润湿剂，可以是非离子型或离子型的，适宜的表面活性剂的例子包括聚丙烯酸和木质素磺酸的钠盐和钙盐；分子中至少含有 12 个碳的脂肪酸或脂肪胺或脂肪酰胺与环氧乙烷和/或环氧丙烷的缩合产物；甘油脂肪酸酯，山梨醇糖，蔗糖或季戊四醇以及它们与环氧乙烷和/或环氧丙烷的缩合物；脂肪醇或烷基酚例如对一辛基苯酚或对一辛基甲酚与环氧乙烷和/或环氧丙烷的缩合产物以及这些缩合产物的硫酸酯或磺酸酯，分子中至

少含有 10 个碳的硫酸酯或磺酸酯的碱金属盐或碱土金属盐,优选钠盐,例如十二烷基硫酸钠,二烷基硫酸钠,磺化的蓖麻油的钠盐,以及烷基芳基磺酸钠如十二烷基苯磺酸钠;及其环氧乙烷的聚合物及环氧乙烷和环氧丙烷的共聚物。

本发明的组合物可以加工成,例如加工成可湿性粉剂,粉剂,粒剂,溶液,乳油,乳剂,浓悬浮剂和气雾剂,可湿性粉剂通常含有 25, 50 或 75 重量百分数的活性组份并且除了固体惰性载体外,通常还含有 3—10 重量百分数的分散剂以及如果需要的活还含有 0—10 重量百分数的稳定剂和/或其它添加剂如渗透剂或粘着剂。粉剂通常加工成浓粉剂,与可湿性粉剂的组成相似但是没有分散剂,在现场用固体载体进一步稀释成含有 0.5—10 重量百分数的活性组份的组合物。粒剂通常制备成大小为 10—100BS 目(英国标准目)(1.676—0.152 毫米),并且可以由烧结或浸透技术来制造。通常,粘剂含有 0.5—75 重量百分数的活性组份和 0—10 重量百分数的添加剂,如稳定剂,表由活化剂,缓释调节剂和粘合剂,所谓“干悬浮粉剂”由相对小的粒剂构成而具有相对高的浓度的活性组份。除溶剂外,当需要时乳油通常含有共溶剂以及 10—50 重量/体积百分数的活性组份,2—20 重量/体积百分数的乳化剂以及 0—20 重量/体积百分数的其它添加剂如稳定剂,渗透剂和防腐剂,悬浮浓剂通常复合成为一个稳定的,非沉积的悬浮产物并且含有 10—75 重量百分数的活性组份,0.5—15 重量百分数的分散剂,0.1—10 重量百分数的悬浮剂如安全胶

体和触变剂, 0—10 重量百分数的其它添加剂如消泡剂, 防腐剂, 稳定剂, 渗透剂和粘着剂, 以及水或有机液体, 而活性组份在这种有机液体中实质是不溶解的, 某些有机固体或无机盐可以溶解在制剂中以促进防止沉淀或者作为水的抗冻剂。

水分散剂和乳剂, 例如用水稀释本发明的可湿性粉剂或浓剂而获得的组合物也属于本发明的范围。所说的乳剂可以是油包水型或水包油型, 并且可以具有浓厚的, 蛋黄酱状的稠度。

本发明的组合物也可含有其它活性组份, 例如具有杀虫或杀菌性质的化合物, 或者其它除草剂。

下述实例对本发明进行了说明。在实例中制备通式 I 所示化合物的结构经质谱和 NMR(核磁共振谱)确认。

实例 1

3—(2—硝基苯基)—5—甲基—5—(α —氟苄氧甲基)异恶唑啉。

(a) 在氮气和搅拌下, 将 2—甲基—2—丙烯—1—醇(12 克)在四氢呋喃(50 毫升)中的溶液滴加到无油氢化钠(4 克)在干燥四氢呋喃(100 毫升)的溶液中。当氢气的释放停止后, 加入 2—氟苄溴(31.5 克), 然后反应混合物在回流下搅拌 1 小时。

真空中除去大部分四氢呋喃, 残留物在氯仿(500 毫升)和水(500 毫升)之间分配。分出有机层, 洗涤, 干燥, 除去溶剂后得到黄色油, 将其在硅胶柱上层析, 氯仿和己烷(50%/50%)的混合物为洗涤剂, 得到无色油(23.4 克, 收率 78%)。此物留在下面的步骤(c)中使

用。(b)2-硝基苯甲醛肟(16.6克)溶解在二甲基甲酰胺(100毫升)中,搅拌下,将N-氯代丁二酰亚胺(1.5克)加入到上述溶液中,将混合物加热到45—50℃以引发反应,然后在1小时内将分解的11.9克N-氯代丁二酰亚胺以每次大约1克的量加入到上述溶液中,为了保持温度在需要的范围内常常需要交替地加热或冷却。将反应混合物冷却后将其倒入水(400毫升)中并用乙醚(2×250毫升)提取,分出有机层,硫酸钠干燥,滤去干燥剂后,醚溶剂直接用于下面的步骤(c)。

(c)将步骤(a)的2-氯苄基烯丙基醚(16.2克;0.09摩尔)加到步骤(b)的醚溶液中,冷却到0℃,然后在1小时内于搅拌下,滴入三乙胺(11克过剩20%)。

滤去三乙胺盐酸盐沉淀,真空中除去滤液的溶剂,得到黄色的油,将其层析(硅胶; CHCl_3)获得淡黄色的油(12.7克,收率41%),此物的光谱特性与指定的结构一致。

实例2—4

按照上述实例1的程序,制备了本发明的其它化合物,这些化合物的详细情况列于下述表1中,通过参考式I的取代基可认证这些化合物。

表 1

实例号	R	X	Y
2	CH ₃	2-NO ₂	H
3	CH ₃	3-NO ₂	H
4	CH ₃	4-NO ₂	H

实例 1—4 中的化合物的物理数据列于下述的表 2 中。

表 2

实例号	熔 点 (°C)	元素分析 (计算值/实验值)			¹ H NMR 或 化学位移 (δ)	裂分数	偶合常数 (Hz)	
		C	H	N				
1	油				7.95-7.2 4.63 3.6 3.15 1.52	m d of d d of d d of d s	J=3.5/2.5 J=5/2 J=22/3.5	8H 芳香环 2H 醚 2H 醚 2H 异噁唑啉 3H 甲基
2	62	66.3 66.6	5.5 5.7	8.6 8.6				
3	油				8.35-7.2 4.6 3.56 3.25 1.48	m d of d d of d d of d s	J=4/2 J=5/2 J=27/3.5	9H 芳香环 2H 醚 2H 醚 2H 异噁唑啉 3H 甲基

表 2 (续)

实例号	熔 点 (°C)	元素分析 (计算值/实验值) 或		¹ H NMR 化学位移 (δ)	裂分数	偶合常数 (Hz)	
		C	H N				
4				8.0	d of d	J=26/2	4H 芳香环
				7.35-7.2	m		AA'BB' 芳香环
				4.62	d of d	J=4/2	2H 醚
				3.58	d of d	J=5/2	2H 醚
				3.25	d of d	J=28/3.5	2H 异噁唑啉
				1.5	s		3H 甲基

实例 5

除草活性

为评介本发明的化合物及其 EP—A—334120 公布的结构相似的化合物的除草活性,采用了下述有代表性的植物:玉米 (*Zea mays*) (M_s); 稻 (*Oryza sativa*) (R); 稗 (*Echinochloa crus-galli*) (BG); 燕麦 (*Avena sativa*) (O); 亚麻子 (*Linum usitatissimum*) (L); 芥末 (*Sinapsis alba*) (M); 甜菜 (*Beta vulgaris*) (SB) 和大豆 (*Cilycine max*) (S)。

试验分为两大类:芽前和芽后,芽前试验是将化合物的液体制剂喷洒在土地上,该土地中新近已播种了上面提到的植物的种子,芽后试验包括两类,即土地浸灌和叶面喷洒,土地浸灌试验是用含本发明化合物的液体制剂浸灌土地,该土地已种植了上述植物的幼苗,而叶面喷洒试验是向植物幼苗喷洒上述的制剂。

试验中所用的土地是精制园艺沃土。

试验中所用的制剂由受试化合物在丙酮中的溶液制备,该溶液中还含有 0.4 重量百分数的烷基酚/环氧乙烷缩合物,商品名 TRI-TON X—115。这些丙酮溶液用水稀释,施用的制剂其剂量水平在土地喷洒和叶面喷洒试验中相当于每公顷 5 千克或 1 千克活性物质,而体积等于每公顷 600 升,而在土地浸灌试验中相当于每公顷 10 千克活性物质,而体积大约等于每公顷 3000 升。

在芽前试验中未处理的已播种的土地,和在芽后试验中未处理的种植有仔苗的土地被用来作为对照。

在叶面喷洒和土地喷洒后的第十二天以及地土地浸灌后的第十三天,观察评定受试化合物的除草效果并按 0—9 个等级来记录,等级 0 表示未处理的对照的生长情况,等级 9 表示死亡,在线性等级上每增加一个单位大约相等于增加 10% 的效果。

试验结果列于表 3 中,其中本发明的化合物与先前的实例一致,表中的空格指示等级为 0。受试的欧洲专利申请说明书中的化合物在表中标出化合物 A 和 B。化合物 A 作为化合物 NO. 49 化合物 B 作为化合物 NO. 118 特别公开于 EP—A—334120 中。由试验结果可见,本发明的化合物在芽前和芽后试验中,对稗(*Echinochloa Crus—galli*)都有一致的高除草效果,即使是降低了试验的剂量,也仍然保持其效果。

表 3 (续)

实例 化合 物号	土地浸灌 10 千克/公顷							剂量 千克/ 公顷	叶面喷洒							芽前试验								
	M ₂	R	BG	O	L	M	SB		S	M ₂	R	BG	L	M	SB	S	M ₂	R	BG	O	L	M	SB	S
3	3	3	8	6			2	5	4	8	5	4	4	3				8						
								1	1	8	4	3	2	2				7						
4								5	2	8	6	4	5	3				5						
								1		7	4	3	2	2				2						

实例 6

除草选择性

(a)研究了应用实例 1 的化合物和化合物 A 和 B(EP—A—334120 的化合物 NO. 49 和 NO. 118 号)对稗和稻的选择性。在这一试验过程中应用的稗的品种为 *Echinochloa crus-galli* , 和 *Echinochloa oryzicola* , 稻为 *Oryza sativa* 。稗的品种 *Echinochloa Crus-galli*(BGP)和 *Echinochloa oryzicola*(BGO)作为直接播种的植物进行试验。稻 *Oryza sativa* 既作为直接播种的植物(RIP)又作为移栽植物(RIT)进行试验,对于直接播种的植物,种子被播种在含消过毒的园艺沃土盆中,播种深 12.5 厘米;当芽出现后,盆中充满水,水面保持在土地表面上 10—20 毫米以模拟水稻田的条件。对于移栽植物,先将仔苗种植在盛有消过毒的园艺沃土的小盆中,待到适当的生长阶级,将其植物和土地一起转移到盛有消过毒的园艺沃土的 12.5 厘米盆中,并灌水至土地表面的 10—20 毫米处。

将化合物溶解了最少量的丙酮中,然后用水稀释,均等地施用 5 毫升溶液于每一个 12.5 厘米水稻盆的水中,这些试验中的剂量水平相当于每公顷施用 0.4, 0.1 和 0.025 千克。

在所有的处理中,每种植物都采用两个重复,十一天后按 0—100 个等级观察评价植物毒性。等级 0 表示未处理时的生长情况;

等级 100 表示死亡。结果列于表 4 中。

表 4

化合物	剂 量 千克/公顷	植物品种			
		BGP	BGO	RIP	RIT
1	0.4	97.00	87.50	0.00	0.00
	0.1	94.00	85.00	0.00	0.00
	0.025	27.50	7.50	0.00	0.00
A	0.4	95.50	65.00	0.00	0.00
	0.1	2.50	2.50	0.00	0.00
	0.025	0.00	0.00	0.00	0.00
B	0.4	86.50	17.50	0.00	0.00
	0.1	2.50	2.50	0.00	0.00
	0.025	0.00	0.00	0.00	0.00

由上述结果可见,在模拟水稻田的条件下这些化合物对稻类植物的生长,无论是直播和或是移植的都无不利的影响,但是本发明的化合物对两种受试的稗都有相当高的除草作用,并且在 0.1 千克/公顷的低剂量下保持着这种除草作用。而文献化合物,虽然在较高剂量的情况下对稗类具有活性,但是在较低剂的情况下却无活性。(b) 评价了本申请实例 2 的化合物和欧洲专利申请说明书的化合物第 53 号(此处称为化合物 c)对稗 *Echinochloa oryzicola* 和稻类植物的作用的选择性。应用的试验程序除剂量水平相当于 2.0,0.6 和 0.2 千克/公顷外,其余与实例 6(a)相同,和上述的实例 6(a)一样,在 14 天后在相同的控制植物生长阶段还评价了植物毒性。

结果列于表 5 中,本发明的化合物再一次显示出对稗类植物的较高的活性,这种活性在 0.2 千克/公顷的低试验剂量下对稗 *Echinochloa oryzicola* 特别显著。

表 5

化合物	剂 量 千克/公顷	植物品种			
		BGP	BGO	RIP	RIT
实例 2	2.0	100.00	92.50	0.00	0.00
	0.6	99.00	90.00	0.00	0.00
	0.2	98.00	85.00	0.00	0.00
C	2.0	100.00	95.00	0.00	0.00
	0.6	98.50	82.50	0.00	0.00
	0.2	91.50	0 00	0.00	0.00

(c)为了使每个试验中涉及到的化合物的活性能进行直接比较,进行了统计评价。对上述(a)和(b)的植物毒性结果由计算机进行了标准概率分析以计算杀死50%和90%稗类植物所需要的每种化合物以千克/公顷计的剂量,这些剂量分别称为 GID_{50} 和 GID_{90} 。很自然,其数量越低,则化合物对杂草越有效,这些统计评价的结果列于表 6a 和 6b 中。

表 6 a

化合物	GID_{50}	
	BGP	BGO
A	0.207	0.361
B	0.240	1.094
C	0.07	0.42
实例 1	0.037	0.064
实例 2	0.04	0.09

表 6 b

化合物	GID ₉₀	
	BGP	BGO
A	0.431	1.492
B	0.499	4.524
C	0.19	2.13
1	0.077	0.264
2	0.11	0.44

由上述结果可见,在两个 2-氟苄氧甲基化合物中间,在实例 1 和化合物 c 中间,实例 1 的化合物有显著低的 GID_{50} 和 GID_{90} 值,表明它是最有效的化合物,实例 1 和实例 2 的化合物,两个 3-(2-硝基苯基)异恶唑啉化合物与与 3-(未取代)苯基化合物 A 和 3-(邻位取代的苯基)化合物 B 相比较显示了有利的低 GID_{50} 和 GID_{90} 值。的确,在每种情况下与文献化合物 A,B,C 相比,本发明的化合物明显地具有较高的活性,而且在重要的水稻杂草 *Echinochloa oryzicola* 上特别显著。